### (12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局

# ZIPO OMPI

# 

# (43) 国際公開日 2003 年10 月23 日 (23.10.2003)

PCT

## (10) 国際公開番号 WO 03/087089 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 401/12, 401/14, 405/14, 409/14, 413/14, 417/14, 487/04, 495/04, A61K 31/454, 31/4709, 31/5377, 31/5415, 31/4545, 31/517, A61P 1/00, 11/00, 11/02, 17/00, 27/02, 29/00, 31/18, 37/08, 43/00, 11/06

(21) 国際出願番号:

PCT/JP03/04841

(22) 国際出願日:

2003 年4月16日 (16.04.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2002-113220 2002年4月16日(16.04.2002) JI

特願2002-240509 2002 年8 月21 日 (21.08.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 帝人株 式会社 (TEIJIN LIMITED) [JP/JP]; 〒541-0054 大阪府 大阪市 中央区南本町 1 丁目 6 番 7 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 *(*米国についてのみ): 松本 由之 (MAT-SUMOTO, Yoshiyuki) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都 日野市旭が丘4丁目3番2号帝人株式会社東京研究センター内 Tokyo (JP). 今井穣 (IMAI, Minoru) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号帝人株式会社東京研究センター内 Tokyo (JP). 澤井善行(SAWAI, Yoshiyuki) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号帝人株式会社東京研究センター内 Tokyo (JP). 竹内進(TAKEUCHI, Susumu) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号帝人株式会社東京研究センター内 Tokyo (JP). 中西顕伸 (NAKANISHI, Akinobu) [JP/JP]; 〒191-0065

東京都 日野市 旭が丘 4 丁目 3 番 2 号 帝人株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 南園 邦夫 (MINAMI-ZONO,Kunio) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都 日野市 旭が 丘 4 丁目 3 番 2 号 帝人株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 横山 朋典 (YOKOYAMA,Tomonori) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都 日野市 旭が丘 4 丁目 3 番 2 号 帝 人株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 三原 秀子 (MIHARA, Hideko); 〒100-0011 東京都 千代田区 内幸町 2 丁目 1 番 1 号 株式会社帝人知的財産センター内 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### 添付公開書類:

#### 一 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PIPERIDINE DERIVATIVES HAVING CCR3 ANTAGONISM

(54) 発明の名称: CCR3拮抗作用を有するピペリジン誘導体

$$\begin{array}{c|c}
R^3N \cdot X - (CH_2)_q & Y \\
N \cdot (CH_2)_p & N \cdot (CH_2)_r & R^7
\end{array}$$
(I)

(57) Abstract: It is intended to provide low-molecular weight compounds having an activity of inhibiting the binding of a CCR3 ligand to CCR3 on a target cell, i.e., CCR3 antagonists. Namely, compounds represented by the following general formula (I), pharmaceutically acceptable acid addition salts thereof or pharmaceutically acceptable  $C_{1-6}$  alkyl

adducts thereof and medicinal compositions having effects of treating and/or preventing diseases in which CCR3 participates such as asthma and allergic nephritis which contain the same as the active ingredient.

WO 03/087089

 $\delta \mathcal{N}_{i}$ 

PCT/JP03/04841

|         | 7        |    | 108 |     |            |                   | _        |
|---------|----------|----|-----|-----|------------|-------------------|----------|
| tors,   | P,       | Ri | R3  | 54  | Ž5         | RG.               | Ry       |
| 1-5-192 | CI CI    | н  | Н   | Н   | Н          | N N               | н        |
| 1-5-193 | CI       | Н  | н   | н   | н          | . N               | <b>H</b> |
| 1-5-194 | CI       | н  |     |     |            | O H               | н        |
| 1-5-195 | CI       | н  | н   | н   | н          | O<br>N.OMe<br>Me  | н        |
| 1-5-196 |          | н  | н   | н   | н          | N COOEt           | н '      |
| 1-5-197 | CI OH    | н  | н   |     |            | OMe               | н        |
| 1-5-198 | СІОН     | н  | н   | н , | <b>H</b> , | N O               | н        |
| 1-5-199 | CIOH     | н  | н   | н   | н          | H N N             | н        |
| 1-5-200 | cı 🗸 🗸 - |    | н   |     |            | O H N O           | н        |
| 1-5-201 | CIOH     |    |     |     |            | O<br>N COOEt<br>H |          |
| 1-5-202 | CI OH    | н  | н   | н   | Н          | COOMe<br>H        | Н        |
| 1-5-203 | CIOH     | н  | н   | Н   | Н          | O<br>H            | н        |

- 35K